

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
16. Dezember 2004 (16.12.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2004/108634 A2**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>:

C07C

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/006315

(22) Internationales Anmeldedatum:  
11. Juni 2004 (11.06.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
103 26 303.9 11. Juni 2003 (11.06.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): CELARES GMBH [DE/DE]; Robert-Rössle-Strasse 10, Haus d 79, 13125 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und  
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): KRÄHMER, Ralf [DE/DE]; Binzstrasse 35, 13189 Berlin (DE). LEENDERS, Frank [DE/DE]; Meyerheimstrasse 7, 10439 Berlin (DE).

(74) Anwalt: WEICKMANN & WEICKMANN; Postfach 860 820, 81635 München (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: REAGENTS FOR MODIFYING BIOPHARMACEUTICALS, THE USE AND PRODUCTION THEREOF

(54) Bezeichnung: REAGENZIEN ZUR MODIFIKATION VON BIOPHARMAZEUTIKA, DEREN HERSTELLUNG UND ANWENDUNG

WO 2004/108634 A2

(57) Abstract: The invention relates to compounds that are suitable to be coupled to pharmaceuticals, especially biopharmaceuticals, and to conjugates on the basis of said compounds with biomolecules or pharmaceutically active agents. The inventive compounds can be produced in a simple manner by multicomponent reactions. Another object of the invention is the use of the conjugates as improved formulation of pharmaceuticals and the production thereof. The invention further relates to a laboratory kit for the *in vitro* production of conjugates on the basis of the inventive compounds and pharmaceuticals and to biotechnological substances, especially biopharmaceuticals, to pharmaceutically active agents, synthetic molecules or surfaces.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Verbindungen, welche zur Kopplung an Pharmazeutika, insbesondere Biopharmazeutika geeignet sind, sowie Konjugate aus den Verbindungen mit Biomolekülen oder pharmazeutischen Wirkstoffen. Die erfundsgemäßen Verbindungen können auf einfache Weise durch Mehrkomponentenreaktionen gebildet werden. Ein weiterer Gegenstand der Erfindung ist die Verwendung der Konjugate als verbesserte Formulierung von Pharmazeutika sowie deren Herstellung. Ferner stellt die Erfindung einen Labor Kit zur *in vitro* Herstellung von Konjugaten aus den erfundsgemäßen Verbindungen und Pharmazeutika sowie biotechnologischen Substanzen, insbesondere Biopharmazeutika, pharmazeutischen Wirkstoffen, synthetischen Molekülen oder Oberflächen zur Verfügung.

**(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG**

**(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro**



**(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
16. Dezember 2004 (16.12.2004)**

**PCT**

**(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2004/108634 A3**

**(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>:** C07D 207/46,  
C07B 61/00, A61K 47/48, 31/40

AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.

**(21) Internationales Aktenzeichen:** PCT/EP2004/006315

**(22) Internationales Anmeldedatum:**  
11. Juni 2004 (11.06.2004)

**(25) Einreichungssprache:** Deutsch

**(26) Veröffentlichungssprache:** Deutsch

**(30) Angaben zur Priorität:**  
103 26 303.9 11. Juni 2003 (11.06.2003) DE

**(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US):** CELARES GMBH [DE/DE]; Robert-Rössle-Strasse 10, Haus d 79, 13125 Berlin (DE).

**(72) Erfinder; und**

**(75) Erfinder/Anmelder (nur für US):** KRÄHMER, Ralf [DE/DE]; Binzstrasse 35, 13189 Berlin (DE). LEENDERS, Frank [DE/DE]; Meyerheimstrasse 7, 10439 Berlin (DE).

**(74) Anwalt:** WEICKMANN & WEICKMANN; Postfach 860 820, 81635 München (DE).

**(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart):** AE, AG, AL,

**(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart):** ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

**(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:** 10. Februar 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

**(54) Title:** REAGENTS FOR MODIFYING BIOPHARMACEUTICALS, THE USE AND PRODUCTION THEREOF

**(54) Bezeichnung:** REAGENZIEN ZUR MODIFIKATION VON BIOPHARMAZEUTIKA, DEREN HERSTELLUNG UND ANWENDUNG

**WO 2004/108634 A3**

**(57) Abstract:** The invention relates to compounds that are suitable to be coupled to pharmaceuticals, especially biopharmaceuticals, and to conjugates on the basis of said compounds with biomolecules or pharmaceutically active agents. The inventive compounds can be produced in a simple manner by multicomponent reactions. Another object of the invention is the use of the conjugates as improved formulation of pharmaceuticals and the production thereof. The invention further relates to a laboratory kit for the *in vitro* production of conjugates on the basis of the inventive compounds and pharmaceuticals and to biotechnological substances, especially biopharmaceuticals, to pharmaceutically active agents, synthetic molecules or surfaces.

**(57) Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft Verbindungen, welche zur Kopplung an Pharmazeutika, insbesondere Biopharmazeutika geeignet sind, sowie Konjugate aus den Verbindungen mit Biomolekülen oder pharmazeutischen Wirkstoffen. Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf einfache Weise durch Mehrkomponentenreaktionen gebildet werden. Ein weiterer Gegenstand der Erfindung ist die Verwendung der Konjugate als verbesserte Formulierung von Pharmazeutika sowie deren Herstellung. Ferner stellt die Erfindung einen Labor Kit zur *in vitro* Herstellung von Konjugaten aus den erfindungsgemäßen Verbindungen und Pharmazeutika sowie biotechnologischen Substanzen, insbesondere Biopharmazeutika, pharmazeutischen Wirkstoffen, synthetischen Molekülen oder Oberflächen zur Verfügung.